

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局(43) 国際公開日  
2005 年 3 月 10 日 (10.03.2005)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 2005/020882 A3(51) 国際特許分類<sup>7</sup>: C07C 229/14,  
229/22, 229/36, 233/47, 255/16, 255/41, 271/22, C07D  
205/04, 211/04, 217/04, 405/06, A61K 31/11, 31/135,  
31/197, 31/198, 31/222, 31/27, 31/277, 31/397, 31/472,  
45/00, A61P 37/06, 37/08, 43/00

(21) 国際出願番号: PCT/JP2004/012768

(22) 国際出願日: 2004 年 8 月 27 日 (27.08.2004)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:  
特願2003-306088 2003 年 8 月 29 日 (29.08.2003) JP  
特願2004-110573 2004 年 4 月 2 日 (02.04.2004) JP  
特願2004-169958 2004 年 6 月 8 日 (08.06.2004) JP  
特願2004-198523 2004 年 7 月 5 日 (05.07.2004) JP(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 小野  
薬品工業株式会社 (ONO PHARMACEUTICAL CO.,  
LTD.) [JP/JP]; 〒541-8526 大阪府 大阪市 中央区道修  
町 2 丁目 1 番 5 号 Osaka (JP).

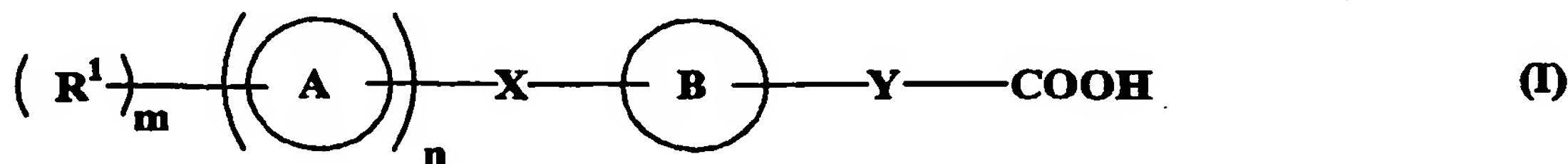
(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 中出 眞嗣  
(NAKADE, Shinji) [JP/JP]; 〒300-4247 茨城県 つく  
ば市 和台 1 7 番地 2 小野薬品工業株式会社内  
Ibaraki (JP). 水野 弘貴 (MIZUNO, Hirotaka) [JP/JP]; 〒  
300-4247 茨城県 つくば市 和台 1 7 番地 2 小野薬品  
工業株式会社内 Ibaraki (JP). 小野 岳児 (ONO, Takeji)  
[JP/JP]; 〒300-4247 茨城県 つくば市 和台 1 7 番地  
2 小野薬品工業株式会社内 Ibaraki (JP). 南 真志  
(MINAMI, Masashi) [JP/JP]; 〒300-4247 茨城県 つく  
ば市 和台 1 7 番地 2 小野薬品工業株式会社内 Ibaraki(JP). 佐賀 寛 (SAGA, Hiroshi) [JP/JP]; 〒300-4247 茨  
城県 つくば市 和台 1 7 番地 2 小野薬品工業株  
式会社内 Ibaraki (JP). 萩谷 洋 (HAGIYA, Hiroshi)  
[JP/JP]; 〒300-4247 茨城県 つくば市 和台 1 7 番地  
2 小野薬品工業株式会社内 Ibaraki (JP). 小宮 貴  
樹 (KOMIYA, Takaki) [JP/JP]; 〒300-4247 茨城県 つ  
くば市 和台 1 7 番地 2 小野薬品工業株式会社内  
Ibaraki (JP). 巾下 広 (HABASHITA, Hiromu) [JP/JP];  
〒618-8585 大阪府 三島郡 島本町桜井三丁目 1 番  
1 号 小野薬品工業株式会社内 Osaka (JP). 倉田 晴  
登 (KURATA, Haruto) [JP/JP]; 〒618-8585 大阪府 三  
島郡 島本町桜井三丁目 1 番 1 号 小野薬品工業株  
式会社内 Osaka (JP). 大槻 和裕 (OHTSUKI, Kazuhiro)  
[JP/JP]; 〒618-8585 大阪府 三島郡 島本町桜井三丁目  
1 番 1 号 小野薬品工業株式会社内 Osaka (JP). 久須  
美 健介 (KUSUMI, Kensuke) [JP/JP]; 〒618-8585 大阪  
府 三島郡 島本町桜井三丁目 1 番 1 号 小野薬品工  
業株式会社内 Osaka (JP).(74) 代理人: 大家 邦久 (OHIE, Kunihisa); 〒103-0013 東京  
都 中央区 日本橋人形町 2 丁目 1 4 番 6 号 セルバ人  
形町 6 階 大家特許事務所 Tokyo (JP).(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が  
可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR,  
BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM,  
DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU,  
ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS,  
LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA,  
NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE,  
SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US,  
UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可  
能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD,  
SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY,  
KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE, BG,

[続葉有]

(54) Title: COMPOUND CAPABLE OF BINDING S1P RECEPTOR AND PHARMACEUTICAL USE THEREOF

(54) 発明の名称: S 1 P 受容体結合能を有する化合物およびその医薬用途

(57) Abstract: A compound capable of binding S1P receptors (especially EDG-6, preferably EDG-1 and EDG-6). For example, a compound of the general formula (I), its salt or solvate, or a prodrug thereof is capable of binding S1P receptors (especially EDG-6, preferably EDG-1 and EDG-6) and is thus useful in the prevention and/or treatment of immunological reaction to transplant, graft versus host disease, autoimmune disease, allergosis, etc. (I) (wherein the ring A is a cyclic group; the ring B is an optionally substituted cyclic group; X is a spacer with a main chain of 1 to 8 atoms, etc.; Y is a spacer with a main chain of 1 to 10 atoms, etc.; and n is 0 or 1 provided that when n is 0, m is 1 and R<sup>1</sup> is a hydrogen atom or a substituent and that when n is 1, m is 0 or an integer of 1 to 7 and R<sup>1</sup> is a substituent, in which when m is 2 or greater, R<sup>1</sup>s may be identical with or different from each other).

[続葉有]



CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).

添付公開書類:

— 国際調査報告書

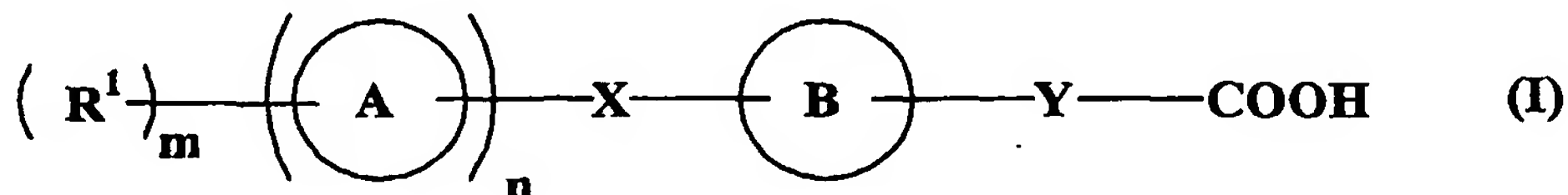
— 請求の範囲の補正の期限前の公開であり、補正書受領の際には再公開される。

(88) 国際調査報告書の公開日: 2005 年4 月21 日

2 文字コード及び他の略語については、定期発行される各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語のガイダンスノート」を参照。

(57) 要約:

S 1 P 受容体（特にEDG-6、好ましくはEDG-1およびEDG-6）結合能を有する化合物、例えば一般式（I）で示される本発明化合物、その塩、その溶媒和物、またはそれらのプロドラッグはS 1 P 受容体（特にEDG-6、好ましくはEDG-1およびEDG-6）結合能を有し、移植に対する拒絶反応、移植片対宿主病、自己免疫性疾患、アレルギー性疾患等の予防および／または治療に有用である。



（式中、環Aは環状基；環Bは置換基を有していてもよい環状基；Xは主鎖の原子数1～8のスペーサー等；Yは主鎖の原子数1～10のスペーサー等；nは0、1；nが0の場合、mは1、かつR<sup>1</sup>は水素原子、置換基；nが1の場合、mは0、1～7の整数、かつR<sup>1</sup>は置換基、かつmが2以上のときR<sup>1</sup>は同じでも異なってもよい）。